

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

**THIS PAGE BLANK (SPTO)**



(51) Internationale Patentklassifikation <sup>6</sup> :  A61K 7/32, 7/48, 7/38, 7/00		A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 99/59537  (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 25. November 1999 (25.11.99)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP99/03068  (22) Internationales Anmeldedatum: 5. Mai 1999 (05.05.99)		(81) Bestimmungsstaaten: AU, BR, CA, CN, CZ, HU, JP, MX, NO, PL, SK, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).	
(30) Prioritätsdaten: 198 21 691.2 14. Mai 1998 (14.05.98) DE 198 32 425.1 18. Juli 1998 (18.07.98) DE		Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i>	
(71) Anmelder ( <i>für alle Bestimmungsstaaten ausser US</i> ): HENKEL KOMMANDITGESELLSCHAFT AUF AKTIEN [DE/DE]: Henkelstrasse 67, D-40589 Düsseldorf (DE).			
(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder ( <i>nur für US</i> ): FÖRSTER, Thomas [DE/DE]; Adalbert-Stifter-Strasse 15, D-40699 Erkrath (DE), CLAAS, Marcus [DE/DE]; Schützenstrasse 70 b, D-40723 Hilden (DE), BANOWSKI, Bernhard [DE/DE]; Benrodestrasse 6, D-40597 Düsseldorf (DE), HEIDE, Barbara [DE/DE]; Heinrich-Klausmann-Strasse 117, D-47809 Krefeld (DE), WADLE, Armin [DE/DE]; Willbecker Strasse 105, D-40699 Erkrath (DE).			
(54) Title: COSMETIC PREPARATIONS IN THE FORM OF A STICK			
(54) Bezeichnung: KOSMETISCHE STIFTPRÄPARATE			
(57) Abstract			
<p>The invention relates to shaped preparations, preferably in the form of a stick, which contain 25–70 wt.% of a material which melts in the range of 25–70 °C and which is made of polar lipids, optionally of non-polar fatty substances, and optionally of active agents dissolved therein. The inventive preparations also comprise 0.1–5.0 wt.% of a water-soluble surfactant, 1–25 wt.% of a water-soluble active agent or solvent, and 20–60 wt.% of water or of a fine-particle emulsion or microemulsion of an oil component having a droplet size which is less than 500 nm. The inventive preparations are suited as supports for water-soluble active agents, e.g. for perspiration-inhibiting aluminum salts or for pigments, for applying said active agents or pigments to the skin. The preferred area of application of the inventive preparations is in deodorant and antiperspirant sticks.</p>			
(57) Zusammenfassung			
<p>Geformte Zubereitungen, bevorzugt in Stift-Form, die 25–70 Gew.-% einer im Bereich von 25–70 °C schmelzenden Masse aus polaren Lipiden und ggf. unpolaren Fettstoffen und ggf. darin gelösten Wirkstoffen, 0,1–5,0 Gew.-% eines wasserlöslichen Tensids, 1–25 Gew.-% eines wasserlöslichen Wirkstoffs oder Lösungsmittels und 20–60 Gew.-% Wasser oder einer feinteiligen Emulsion oder Mikroemulsion einer Ölkomponente mit einer Tröpfchengröße unter 500 nm enthalten, eignen sich als Träger für wasserlösliche Wirkstoffe, z.B. für schweißhemmende Aluminiumsalze oder für Pigmente, zur Applikation dieser Wirkstoffe oder Pigmente auf die Haut. Das bevorzugte Anwendungsgebiet sind Deodorant- und Antitranspirant-Stifte.</p>			

**LEDIGLICH ZUR INFORMATION**

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Amenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	IU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauritanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NI	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Estland						

### „Kosmetische Stiftpräparate“

Die Erfindung betrifft geformte Zubereitungen, bevorzugt in der Form eines Stiftes zum Auftrag wasserlöslicher kosmetischer Wirkstoffe auf die Haut.

Kosmetische und dermatologische Stiftpräparate zur Applikation wasserlöslicher Wirkstoffe kommen üblicherweise in zwei Varianten auf den Markt: Entweder in der Form eines Gels, bei dem der Wirkstoff in einem durch ein Geliermittel, z.B. eine Seife, verfestigten wäßrigen Alkohol oder Polyol gelöst ist, oder in Form von Suspensionsstiften, die in einem wasserfreien, mit Wachs verfestigten Öl, z.B. einem Siliconöl, den Wirkstoff dispergiert enthalten.

Die Seifengel-Stifte haben den Nachteil, daß sie aufgrund des Geliermittels einen alkalischen pH-Wert aufweisen und daher Probleme bei der Einarbeitung saurer Wirkstoffe, z.B. des Aluminiumchlorhydrats oder anderer saurer Antitranspirant-Wirkstoffe bereiten. Die wasserfreien Dispersionsstifte, insbesondere solche auf Basis von flüchtigen Siliconölen haben den Nachteil, daß die dispergierten Wirkstoffe leicht zu sichtbaren Produktrückständen auf der Haut und auf der Kleidung führen. Außerdem sind solche Stifte relativ kostspielig, da die Ölkomponenten als Wirkstoffträger teurer sind als Wasser.

Daneben sind auch emulsionsförmige Stiftzubereitungen beschrieben worden. Aus EP-A-0 291 334 ist z.B. ein transparenter Antitranspirant-Stift bekannt, der hohe Mengen eines

flüssigen Öls enthält, das mit Hilfe eines hydrophilen Emulgators und Wasser zu einem transparenten Mikroemulsions-Gel verarbeitet ist. Solche Gele sind aus der Literatur auch als „ringing gel“ bekannt und hinterlassen beim Auftrag auf die Haut einen schmierigen Film, der vom Anwender sehr unangenehm empfunden wird. Aus WO 96/06594 war eine Wasser-in-Öl-Antitranspirant-Zusammensetzung bekannt, die jedoch nicht die für ein Stiftpräparat erforderliche Festigkeit und Formbeständigkeit aufweist.

Es bestand daher die Aufgabe, ein kosmetisches Stiftpräparat zu entwickeln, das sich als Träger für wasserlösliche Wirkstoffe oder für Pigmente eignet, das die gewünschte mechanische Festigkeit bei Umgebungstemperatur aufweist und einen ausreichenden, nicht schmierigen Abrieb bei der Applikation auf der Haut hinterlässt, der sich nach Verdunstung des Wassers trocken anfühlt.

In der deutschen Patentanmeldung DE 198 21 691.2 sind bereits Stiftpräparate, die als Dispersionen von Lipid- und Wachskristallen in Wasser vorliegen und durch geringe Mengen hydrophiler Tenside stabilisiert werden, beschrieben. Diese Stiftpräparate sind zwar bezüglich Festigkeit, Abgabevermögen und Kühlwirkung auf der Haut recht befriedigend, es bestand jedoch der Wunsch, das Hautgefühl und die Pflegewirkung noch weiter zu verbessern.

Diese Aufgabe wurde erfindungsgemäß gelöst durch eine geformte Zubereitung zur Applikation wasserlöslicher Wirkstoffe auf der Haut, bevorzugt in Stift-Form, gekennzeichnet durch einen Gehalt von

25 - 70 Gew.-% einer im Bereich von 25 – 70°C schmelzenden Masse, bestehend aus

- (A) wenigstens 60 Gew.-% eines oder mehrerer polarer Lipide und
- (B) bis zu 40 Gew.-% unpolarer Fettstoffe und ggf. in dieser Masse gelöster kosmetischer oder dermatologischer Wirkstoffe

0,1 - 5 Gew.-% eines wasserlöslichen Tensids

1 - 25 Gew.-% eines wasserlöslichen Wirkstoffs und/oder Lösungsmittels

20 - 60 Gew.-% Wasser oder einer feinteiligen Emulsion oder Mikroemulsion einer Ölkomponente mit einer Tröpfchengröße unter 500 nm.

Die erfundungsgemäßen geformten Zubereitungen sind Dispersionen von Lipid- und Wachskristallen, die durch sehr geringe Mengen von hydrophilen Tensiden stabilisiert werden und die aufgrund ihres Wassergehaltes bei der Anwendung einen frischen, leicht kühlen Eindruck auf der Haut hinterlassen, der sie insbesondere für kosmetische Anwendungen im Bereich der Deodorantien sehr geeignet macht. Die Struktur ist fest und stabil genug, um daraus Stifte zu formen und das Schmelzverhalten ist einerseits durch die Art der Lipide und Fettstoffe, andererseits durch die Struktur und Zusammensetzung der Zubereitungen so beschaffen, daß beim Bestreichen der Haut durch die Körpertemperatur ein Schmelzvorgang eingeleitet wird, der eine gleichmäßige Abgabe der Stiftmasse an die Haut ermöglicht. Darüber hinaus wird durch die feinstemulgierten Ölkomponenten, die bevorzugt in einer Menge von 0,1 – 10 Gew.-% in den Zubereitungen enthalten sind, ein glattes und kosmetisch befriedigendes Hautgefühl und eine gute Pflegewirkung auf der Haut erzielt.

Die erfundungsgemäßen Zubereitungen eignen sich insbesondere, um kosmetische oder dermatologische Wirkstoffe auf die Haut zu bringen. Es kann sich dabei entweder um lipophile, fettlösliche Wirkstoffe handeln, die in der Lipidphase gelöst werden, oder um wasserlösliche Wirkstoffe. Letztere stellen für konventionelle Stiftmassen ein besonderes Problem dar, da diese entweder wasserfrei sind oder mit Seifen verfestigte Gele darstellen. Die mit zahlreichen wasserlöslichen Wirkstoffen unverträglich sind. Die erfundungsgemäßen Zubereitungen enthalten aber eine äußere wässrige Phase, in der beliebige wasserlösliche Wirkstoffe gelöst sein können.

Die dispergierte Lipidphase, die aus wenigstens 60 Gew.-% eines oder mehrerer polarer Lipide (A) und bis zu 40 Gew.-% unpolarer Fettstoffe besteht, sollte bei 25°C fest sein, aber im Bereich von 25 – 70°C schmelzen, wobei es bevorzugt ist, wenn ein Teil dieser Phase bereits bei Temperaturen unter 35°C zu schmelzen beginnt.

Als polare Lipide (A) werden dabei Fettstoffe verstanden, die in Wasser weitgehend unlöslich sind, aber polare Gruppen, z.B. Hydroxylgruppen oder Carboxylgruppen sowie lipophile, bevorzugt lineare Alkyl- oder Acylgruppen mit 8 – 22 C-Atomen aufweisen. Beispiele solcher geeigneter polarer Lipide sind z.B. Fettsäuren oder Fettalkohole.

Fettsäuremonoethanolamide oder Fettsäuremonoisopropanolamide. Fettsäure-mono- oder Diglyceride, Fettsäuremono- oder -diester des Sorbitans oder Methylglucosids, jeweils von Fettsäuren mit 8 – 22 C-Atomen.

Bevorzugte polare Lipide zur Herstellung der erfundungsgemäßen Zubereitungen sind ausgewählt aus Fettsäuren oder Fettalkoholen mit 12 – 22 C-Atomen. Partialestern von Fettsäuren mit 12 – 22 C-Atomen und Glycolen oder Polyolen mit 2 – 10 C-Atomen. Fettsäuremonoalkanolamiden mit 12 – 22 C-Atomen im Acylrest und 2 – 4 C-Atomen im Alkanolrest.

Geeignet sind auch die technisch leicht zugänglichen, durch Veresterung von Glycerin oder Sorbit mit 1 – 2 Mol Fettsäure erhältlichen Estergemische. Weitere geeignete polare Lipide sind die Fettsäuremono- und Diestergemische des Methylglucosids oder des Butylglucosids oder des Diglycerins sowie Fettalkohole mit 16 – 40 C-Atomen..

Als unpolare Fettstoffe (B) eignen sich alle bekannten physiologisch verträglichen Fette, Wachse und Paraffine. Geeignete Wachse sind z.B. Bienenwachs, Carnaubawachs, Candelillawachs, Walrat oder synthetische Fettsäure-Fettalkoholester wie z.B. Cetylpalmitat oder Stearylstearat. Bevorzugt geeignete unpolare Fettstoffe sind vor allem Paraffinwachse oder Triglyceride von gesättigten C<sub>10</sub>-C<sub>22</sub>-Fettsäuren oder von Hydroxystearinsäure. Beispiele für gesättigte Triglyceride sind vor allem gehärtete Triglyceridfette, z.B. geh. Kokosöl, geh. Palmöl oder geh. Ricinusöl. Andere geeignete unpolare Fettstoffe sind die synthetischen Vollester aus Fettsäuren und Glycolen oder Polyolen mit 2 – 6 C-Atomen z.B. 1,2-Propylenglycol-distearat oder Ethylenglycol-dipalmitat sowie Vollester aus Fettalkoholen und Di- oder Tricarbonsäuren, z.B. Dicetylsuccinat oder Dicetyl-/stearyl-adipat.

Es ist nicht erforderlich, daß die Komponenten der bei 25 – 70°C schmelzenden Masse ebenfalls innerhalb dieses Temperaturbereiches schmelzen, vielmehr kann eine Komponente oder ein Teil einer Komponente auch bei 25°C noch flüssig sein. Wichtig ist, daß die Masse der Lipide (A + B) sowie der gegebenenfalls enthaltenen lipophilen

WO 99/59537

5

Wirkstoffe im Gemisch ein Schmelzverhalten zeigt, das bei 25 – 35°C beginnt und bis 70°C zu einer klaren Schmelze führt.

Als lipophile, öllösliche Wirkstoffe können z.B. öllösliche Vitamine, z.B. Tocopherole, Retinol-Derivate, öllösliche Deodorantien, z.B. Triethylcitrat, öllösliche UV-Filter-Substanzen sowie alle bekannten in der Lipidschmelze löslichen kosmetischen oder dermatologischen Wirkstoffe enthalten sein.

Als wasserlösliche Tenside sind prinzipiell alle oberflächenaktiven Stoffe geeignet, die in Wasser bei 20°C eine Löslichkeit von wenigstens 1 Gew.-%, bevorzugt aber von 10 Gew.-%, aufweisen. Es ist dabei gleichgültig, ob diese Tenside nichtionogen oder ionogen, z.B. anionisch, zwitterionisch, amphoter oder kationisch sind. Gemeinsames Merkmal solcher Tenside ist eine bevorzugt lineare Alkyl-, Alkenyl- oder Acylgruppe mit 8 – 18 C-Atomen sowie eine löslichmachende Gruppe, z.B. eine Sulfat- oder Sulfonat-Gruppe, eine Carboxylat-Gruppe, eine Polyol- oder Polyglycolether-Gruppe oder eine Aminoxid-Gruppe. Geeignete anionische Tenside sind z.B. Alkylsulfate und Alkansulfonate, α-Olefinsulfonate, Acylsethionate, Acyltauride und Acylsarkosinate sowie Alkyl-polyglycolethersulfate, alle in Form ihrer Alkali-, Ammonium- oder Alkanolammonium-Salze.

Geeignete zwitterionische Tenside sind z.B. Betaintenside wie Alkyl-dimethylacetobetain oder Acylamidopropyl-dimethylacetobetain.

Geeignete Amphotenside sind z.B. N-Alkylaminopropionsäure oder N-Alkylamino-buttersäure.

Bevorzugt geeignete wasserlösliche Tenside für die Zwecke der erfundungsgemäßen geformten Zubereitungen sind nichtionogene Tenside, z.B. Anlagerungsprodukte von 10 – 30 Mol Ethylenoxid an Fettalkohole, Fettsäuren, Fettsäurealkanolamide, Fettsäure-monoglyceride, Sorbitanfettsäureester, Methylglucosid-Fettsäureester oder polyglycol-ethermodifizierte Polysiloxane. Besonders bevorzugt sind solche nichtionischen Tenside, die frei von Glycolethergruppen sind und deren hydrophile Gruppe durch einen Oligo-

glucosidrest gebildet wird. Solche Tenside stehen als Alkylglucoside, Alkyloligoglucoside oder Alkylpolyglucoside unter dem Warenzeichen Plantacare® zur Verfügung. Sie enthalten eine glucosidisch gebundene C<sub>10</sub>-C<sub>16</sub>-Alkylgruppe an einem (Oligo)-glucosidrest, dessen mittlerer Oligomerisationsgrad bei 1 – 2 liegt. Auch die vom Glucamin abgeleiteten Acylglucamide sind als Tenside geeignet.

Als wasserlösliche Wirkstoffe können alle kosmetisch oder dermatologisch wirksamen Stoffe eingesetzt werden, die in Wasser bei 20°C zu wenigstens 1 Gew.-% klar löslich sind. Solche Stoffe sind z.B. anionische oder kationische Wirkstoffe, die in Salzform wasserlöslich sind, z.B. Vitamine wie Biotin (Vitamin H), Ascorbinsäure (Vitamin C), Tretinoin (Vitamin-A-Säure), Pantothenäsäure oder Sonnenschutzwirkstoffe wie 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure, 2-Hydroxy-4-methoxy-benzophenon-5-sulfonsäure, Hautbefeuchtungsmittel wie z.B. DL-2-Pyrrolidon-5-carbonsäure oder Chitosan-Salze, antimikrobielle Stoffe wie z.B. Chlorhexidin-gluconat, Benzoësäure, Sorbinsäure und keratolytische Stoffe wie z.B. Na-Thioglycolat, Sebostatika, Hautaufheller wie z.B. Ascorbylphosphat und Anti-Akne-Wirkstoffe.

Weitere wasserlösliche kosmetische Wirkstoffe sind z.B. anorganische Salze wie z.B. Alaun (K Al(SO<sub>4</sub>)<sub>2</sub>, 12H<sub>2</sub>O), der als blutstillender und deodorierender Stoff eingesetzt wird. Als solche sind bevorzugt keratinhartende schweißhemmende Salze, insbesondere Aluminiumsalze, enthalten. Außer dem bereits genannten Alaun eignen sich hierfür z.B. Aluminiumhydroxychlorid, Aluminiumlactat, Natriumaluminium-Chlorhydroxylactat, Aluminiumchlorhydroxyallantoinat, Aluminium-Zirkon-Tetrachlorhydrat-Glycinkomplexe oder Gemische davon.

Weitere wasserlösliche Wirkstoffe, die mit Hilfe der erfindungsgemäßen Zubereitungen auf die Haut gebracht werden können, sind z.B. Hautpigmentierungsmittel und Färbemittel, z.B. Dihydroxyaceton, Alloxan oder 5,6-Dihydroxyindolin-Salze.

Auch entzündungshemmende und die Heilung fördernde Stoffe wie z.B. Allantoin, Panthenol und verschiedene wässrige oder wasserlösliche Pflanzenextrakte, Proteinhydrolysate und Harnstoff können als wasserlösliche Wirkstoffe eingesetzt werden.

Als Pigmente können z.B. Titandioxid, Kaolin, Talkum, Zinkoxid, Zinkstearat, Calciumstearat, Magnesiumstearat, Magnesiumsilikat, Bariumsulfat und Farbpigmente, z.B. Eisenoxid-Pigmente enthalten sein.

Schließlich kann die erfindungsgemäße Zubereitung neben dem Wasser auch wasserlösliche Lösungsmittel enthalten, die aber in ihrer Menge nicht den Gehalt an Wasser übersteigen sollten. Als wasserlösliche Solventien eignen sich vor allem die niederen Alkohole mit 1 – 3 C-Atomen, die Glycole und Polyole sowie die Polyalkylenglycole, die mit Wasser im Verhältnis 1 : 1 bei 20°C klar mischbar sind. Geeignete Solventien sind z.B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propylenglycol, Sorbit, Glycerin, Diglycerin oder Polyethylenglycole mit Molgewichten von 200 – 10000.

Durch den Anteil des wasserlöslichen Solvens lassen sich die Festigkeit, das Abgabevermögen (Abrieb an der Haut) und das Hautgefühl sehr gut steuern. So wirken Zubereitungen, die niedere Alkohole wie z.B. Ethanol oder Isopropanol enthalten, oder die einen hohen Wassergehalt aufweisen, angenehm kühlend auf der Haut. Bevorzugt sind in den erfindungsgemäßen geformten Zubereitungen 25 – 60 Gew.-% Wasser oder eines Gemisches aus Wasser und bis zu 10 Gew.-% eines wasserlöslichen Glycols oder Polyols mit 2 – 6 C-Atomen enthalten.

Der Abrieb, d.h. die beim Bestreichen an die Haut abgegebene Menge kann man durch das Mengenverhältnis von polaren und unpolaren Lipiden, dem Gehalt an wasserlöslichem Tensid und dem Verhältnis von Lipidphase zu Wasserphase steuern. Diese Mengenverhältnisse haben auch Einfluß auf das Schmelzverhalten der Stiftmasse, das zwar überwiegend – aber nicht ausschließlich – durch das Schmelzverhalten der Lipidphase bestimmt wird.

Zur Verbesserung des Hautgefühls und der Pflegewirkung kann man den erfindungsgemäßen Zubereitungen auch kosmetische Ölkomponenten zusetzen. Dies kann jedoch nur in begrenztem Umfang durch Zusatz zur Lipidmasse oder durch getrenntes Einemulgieren erfolgen, ohne daß die Stabilität des Systems gefährdet oder gar zerstört

wird. Es hat sich aber gezeigt, daß solche Ölkomponenten in Form einer besonders feinteiligen Öl-in-Wasser-Emulsion mit einer Tröpfchengröße unter 500 nm, bevorzugt unter 300 nm, in einer Menge von 0,1 – 10 Gew.-% problemlos in der Wärme und vor dem Erstarren in die Zusammensetzung eingearbeitet werden können.

Als Ölkomponenten eignen sich alle wasserunlöslichen, hautverträglichen Öle und Fettstoffe, die bei Raumtemperatur flüssig sind, zumindest aber einen Schmelzpunkt unterhalb von 40° C aufweisen. Bevorzugt geeignet sind die bei 20° C noch flüssigen Kohlenwasserstoffe. z.B. Paraffinöle oder Polyolefine und synthetische Kohlenwasserstoffe wie z.B. 1,3-Di-(2-ethyl-hexyl)-cyclohexan (Cetiol®S). Eine weiterhin sehr bevorzugte Ölkomponente sind die Di-n-alkylether mit insgesamt 12 – 24 C-Atomen wie z.B. Di-n-octylether, Di-(2-ethylhexyl)-ether, Lauryl-methylether oder Octyl-butylether.

Eine besonders vielseitige Gruppe von kosmetischen Ölkomponenten ist die der Fettsäure- und Fettalkoholester, z.B. Isopropylmyristat, n-Butylstearat, 2-Ethylhexyl-caprylat, Cetyloleat, Glycerin-tricaprylat, Kokosfettalkohol-(C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>)-caprylat/-aprinat, Hexyl-decyllaurat und andere. Geeignet sind auch natürlich vorkommende Esteröle wie z.B. Jojobaöl oder pflanzliche Triglyceridöle wie z.B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Rapsöl, Mandelöl sowie die flüssigen Anteile des Kokosöls oder des Rindertalg s sowie synthetische Triglyceridöle. Auch Dicarbonsäureester wie z.B. Di-n-butylsebacat, Di-n-butyl-adipat, Di-isotridecyl-acetat, Di-2-ethylhexyl-succinat eignen sich als Ölkomponente.

Auch lineare und cyclische Polysiloxane (Silikonöle) können als Ölkomponenten enthalten sein. Die Ölkomponenten sind bevorzugt ausgewählt aus flüssigen Kohlenwasserstoffen, Di-n-alkylethern, Fettsäure- oder Fettalkoholestern und Silikonölen.

Schließlich kann die erfindungsgemäße geformte Zubereitung auch noch weitere Hilfs- und Zusatzmittel enthalten, die zur Erzielung der gewünschten Eigenschaften und Wirkungen erforderlich sein können. Es handelt sich dabei aber um übliche Komponenten wie z.B. Duftstoffe, Farbstoffe, Verdickungsmittel, Pigmente, Talkum, Schichtsilikate, Stärken,

Konservierungsmittel und Antioxidantien, die insgesamt in einer Menge von bis zu 1.0 Gew.-% in der Zubereitung enthalten sein können. So kann z.B. die Stabilität der Zubereitungen während des Herstell- und Abfüllvorganges durch Zugabe wasserquellender Verdickungsmittel (z.B. wasserlösliche Celluloseether, Polyvinylpyrrolidon, Polyvinylalkohol, modifizierter Stärke, hydroxypropylirter Stärkephosphate oder wasserlöslicher Acrylsäure-Acrylat-Copolymere und anderer) merklich verbessert werden. Zur Beeinflussung des Hautgefühls können z.B. Stärken, Talkum, Nanosphären oder Silikonöl in geringen Mengen zugesetzt werden.

Die folgenden Beispiele sollen den Gegenstand der Erfindung näher erläutern:

**B e i s p i e l e****1. Ölfreie Deodorant-Stifte**

Die in der folgenden Tabelle aufgeführten Beispiele für erfindungsgemäße Stiftmassen wurden wie folgt hergestellt:

Polare Lipide und unpolare Fettstoffe (Wachse und Paraffine) und das Tensid wurden zusammengegeben und gemeinsam auf 80°C bis zur klaren Schmelze erwärmt. In diese heiße Fettpfase wurde das Gemisch aus Wasser, wasserlöslichen Glycolen und Polyolen und dem Aluminiumhydroxychlorid unter Rühren bei 80°C eingearbeitet. Es bildete sich eine Emulsion, die noch vor dem Erstarren das Parfümöl und ggf. Talkum zugesetzt wurde.

	<b>1</b>	<b>2</b>	<b>3</b>	<b>4</b>	<b>5</b>	<b>6</b>
Glycerinmonolaurat	19,7	19,7	30	20	30	30
Glycerinmonostearat	10,0	-	-	-	-	-
Glycerinmonooleat	-	10,0	-	-	-	-
Behenylalkohol	-	-	-	-	-	5
Cetyl-/stearylalkohol	0,15	0,15	0,15	0,15	0,15	0,15
Paraffinwachs 5213	20,0	20,0	-	-	-	-
hydr. Ricinusöl	-	-	-	10,0	5,0	-
Alkylpolyglucosid	0,15	0,15	0,15	0,15	0,15	0,15
Aluminiumchlorhydrat	20,0	20,0	20,0	10,0	20,0	20,0
1,2-Propylenglycol	3,0	3,0	3,0	-	-	-
Glycerin	-	-	-	3,0	3,0	3,0
Parfümöl	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0
Talkum	-	-	-	-	-	5,0
Wasser	26	26	45,7	55,7	40,7	35,7

	7	8	9	10	11	12
Glycerinmonolaurat	30,0	30,0	30,0	20,0	20,0	25,0
Glycerinmonopalmitat	-	-	-	10,0	-	-
Glycerinmonostearat	-	-	-	-	10,0	-
Cetyl-/Stearylalkohol	0,15	0,3	0,3	0,15	0,15	0,3
Paraffinwachs 5213	-	-	-	-	-	-
hydr. Ricinusöl	10,0	10,0	10,0	5,0	5,0	15,0
Alkylpolyglucosid	0,15	0,3	0,3	0,15	0,15	0,3
Aluminiumchlorhydrat	20,0	20,0	20,0	20,0	20,0	20,0
1,2-Propylenglycol	-	--	-	-	-	-
Glycerin	3,0	3,0	3,0	3,0	3,0	3,0
Parfümöl	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0
Talkum	-	-	5,0	-	-	-
Wasser	35,7	35,4	30,4	40,7	40,7	35,4

	13	14	15	16	17	18
Glycerinmonolaurat	20,0	20,0	20,0	20,0	20,0	20,0
Glycerinmonopalmitat	-	5,0	5,0	-	-	-
Cetyl-/Stearylalkohol	0,3	0,3	0,5	0,3	0,3	-
Paraffin 69-73	-	10,0	7,5	-	-	-
hydr. Ricinusöl	10,0	5,0	7,5	10,0	10,0	10,0
Cyclomethicone	-	-	-	-	0,5	-
Dimethiconecopolyol	-	-	-	-	-	2,0
Alkylpolyglucosid	0,3	0,3	0,5	0,3	0,3	-
Aluminiumchlorhydrat	20,0	20,0	20,0	20,0	20,0	20,0
Talkum	5,0	-	-	-	-	-
Reisstärke	2,0	-	-	2,0	1,0	1,0
Parfümöl	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0
Wasser	41,4	38,4	38,0	46,4	46,9	46,0

Beim Erreichen der Erstarrungstemperatur bildete sich eine noch fließfähige Dispersion, die ausreichend stabil war, um sie in Stifthülsen abzufüllen. Nach der Abfüllung erstarnten die Massen in der Stifthülse zu einer festen Masse.

In der folgenden Tabelle sind die Schnelzeigenschaften der Beispiele 1 – 18 (nach Messung mit einem Differential Scanning Calorimeter) aufgeführt: Die Unterschiede zwischen den Schmelzmaxima und den Erstarrungsmaxima erklären sich durch Kristallisationsverzögerungen bzw. Neigung zur Unterkühlung.

## 2.2 Mikroemulsionen

Di-n-Octylether	28,0
2-Octyl-dodecanol	7,0
Glycerinmonooleat	5,0
Laurylglucosid	12,0
Decylglucosid	8,0
Wasser	39,0

## 3. Antitranspirant-Cremestifte mit Ölkomponenten

(die %-Angaben der Handelsprodukte beziehen sich auf wasserfreie Aktivsubstanz)

	19	20	21	22	23	24	25	26	27
Monomuls 90-L-12	20	20	20	20	20	20	20	20	20
Cutina HR	10	10	10	-	-	-	-	-	-
Eanette 22	-	-	-	5	7	7	7	7	7
Paraffinwachs 69-73	-	-	-	8	5	5	5	5	5
Emulgade PL 68/50	1	1	1	2	2	2	2	2	2
Aluminiumchlorhydrat	20	20	10	10	10	10	10	10	10
Talcum Pharma S	-	-	-	5	5	-	-	-	-
Parfümöl	1	1	1	1	1	1	1	1	1
PIT-Emulsion 2.1	5	10	3	10	10	10	5	-	-
Mikroemulsion 2.2	-	-	-	-	-	-	-	3	6,4
Wasser	42	38	55	39	40	45	50	52	48,6

### Herstellung:

Die Herstellung erfolgte analog Beispiel 1 – 18, die Emulsionskonzentrate 2.1 bzw. 2.2 wurden zuletzt während der Abkühlung bei einer Temperatur der Masse von ca. 55°C unter Rühren eingearbeitet.

## 2.2 Mikroemulsionen

Di-n-Octylether	28,0
2-Octyl-dodecanol	7,0
Glycerinmonooleat	5,0
Laurylglucosid	12,0
Decylglucosid	8,0
Wasser	39,0

## 3. Antitranspirant-Cremestifte mit Ölkomponenten

(die %-Angaben der Handelsprodukte beziehen sich auf wasserfreie Aktivsubstanzen)

	19	20	21	22	23	24	25	26	27
Monomuls 90-L-12	20	20	20	20	20	20	20	20	20
Cutina HR	10	10	10	-	-	-	-	-	-
Łanette 22	-	-	-	5	7	7	7	7	7
Paraffinwachs 69-73	-	-	-	8	5	5	5	5	5
Emulgade PL 68/50	1	1	1	2	2	2	2	2	2
Aluminiumchlorhydrat	20	20	10	10	10	10	10	10	10
Talcum Pharma S	-	-	-	5	5	-	-	-	-
Parfümöl	1	1	1	1	1	1	1	1	1
PIT-Emulsion 2.1	5	10	3	10	10	10	5	-	-
Mikroemulsion 2.2	-	-	-	-	-	-	-	3	6,4
Wasser	42	38	55	39	40	45	50	52	48,6

## Herstellung:

Die Herstellung erfolgte analog Beispiel 1 – 18, die Emulsionskonzentrate 2.1 bzw. 2.2 wurden zuletzt während der Abkühlung bei einer Temperatur der Masse von ca. 55°C unter Rühren eingearbeitet.

**Vergleichsversuch:**

Es wurde versucht, in die Zusammensetzung des Beispiels 21 anstelle der PIT-Emulsion 2.1 eine grobteilige Emulsion (mittlere Teilchengröße 2000 nm) einzuarbeiten. Dabei wurde eine Masse erhalten, die nicht zu einem festen Stift erstarrte.

**4. Make-Up Stifte (28 – 31)****Moisturizer-Stifte (32, 33)****Hautaufheller-Stifte (34, 35)**

(Die %-Angaben der Handelsprodukte beziehen sich auf wasserfreie Aktivsubstanz)

	28	29	30	31	32	33	34	35
Monomuls 90-L-12	20	20	20	20	20	20	20	20
Lanette 22	8	8	9	9	8	8	8	9
Paraffinwachs 69-73	5	5	5	5	5	5	5	5
Emulgade PL 68/50	2	2	2	2	2	2	2	2
Talcum Pharma S	1,5	1,5	1,5	1,5	-	-	-	-
TiO <sub>2</sub>	3	3	3	3	-	-	-	-
Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub> (Braun 70)	0,7	0,7	0,7	0,7	-	-	-	-
Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub> (Braun 75)	0,25	0,25	0,25	0,25	-	-	-	-
Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub> (Gelb 10)	0,10	0,10	0,10	0,10	-	-	-	-
Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub> (Rot 30)	0,02	0,02	0,02	0,02	-	-	-	-
Na-Hyaluronat	-	-	-	-	0,1	0,1	-	-
Herbasol-Extrakt Salbei	-	-	-	-	1,0	2,0	-	-
Aqua Hamamelis	-	-	-	-	1,0	2,0	-	-
Mg-Ascorbylpalmitat	-	-	-	-	-	-	0,5	0,75
PIT-Emulsion 2.1	5,0	7,5	5,0	7,5	5,0	7,5	5,0	7,5
Konservierungsmittel	1,55	1,55	1,55	1,55	1,55	1,55	1,55	1,55
Parfümöl	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0
Wasser	51,88	49,38	50,58	48,38	55,35	50,85	56,95	53,2

Die Herstellung erfolgte Analog Beispiel 19 – 27. Die Pigmente wurden nach der PIT-Emulsion 2.1 bei ca. 50°C in die Masse eingearbeitet. Als Konservierungsmittel wurde eine Kombination aus p-Hydroxybenzoësäure-methylester, -propylester und Phenoxyethanol (0,3 + 0,3 + 0,95 Gew.-%) eingesetzt.

Es wurden die folgenden Handelsprodukte verwendet:

Abil K4	: Octamethylcyclotetrasiloxan (Cyclomethicone)
Abil B 8843	: Dimethiconecopolyol
Emulgade PL 68/50	: Gemisch aus Alkyl-(C <sub>16-18</sub> )-polyglucosid und Cetyl-/Stearylalkohol (1 : 1)
Cetiol PGL	: Hexyldecyl-laurat
Nexbase 2006 FG	: Polydecen
Mergital B 10	: Behenylalkohol-poly-(10)-glycolether
Plantacare 1200	: Laurylglucosid
Plantacare 2000	: Decylglucosid
Monomuls 90-L-12	: Glycerinmonolaurat
Monomuls 90-0-18	: Glycerinmonooleat
Cetiol OE	: Di-n-octylether
Eutanol G	: 2-Octyl-dodecanol
Cutina HR	: Hydr. Ricinusöl
Lanette 22	: Behenylalkohol
Locron L	: Al-chlorhydrat

## Patentansprüche

1. Geformte Zubereitung zur Applikation wasserlöslicher Wirkstoffe auf der Haut, bevorzugt in Stift-Form, gekennzeichnet durch einen Gehalt von  
 25 - 70 Gew.-% einer im Bereich von 25 - 70°C schmelzenden Masse, bestehend aus
  - (A) wenigstens 60 Gew.-% eines oder mehrerer polarer Lipide und
  - (B) bis zu 40 Gew.-% unpolarer Fettstoffe und ggf. in dieser Masse gelöster kosmetischen oder dermatologischen Wirkstoffen
  - 0.1 - 5 Gew.-% eines wasserlöslichen Tensids
  - 1 - 25 Gew.-% eines wasserlöslichen Wirkstoffs und/oder Lösungsmittels
  - 20 - 60 Gew.-% Wasser oder einer feinteiligen Emulsion oder Mikroemulsion einer Ölkomponente mit einer Tröpfchengröße unter 500 nm..
2. Zubereitung gemäß Patentanspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die polaren Lipide (A) ausgewählt sind aus Fettsäuren oder Fettalkoholen mit 12 - 22 C-Atomen, Partial-estern von Fettsäuren mit 12 - 22 C-Atomen und Glycolen oder Polyolen mit 2 - 10 C-Atomen, Fettsäuremonoalkanolamiden mit 12 - 22 C-Atomen im Acylrest und 2 - 4 C-Atomen im Alkanolrest.
3. Zubereitungen gemäß Patentanspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß die polaren Lipide (A) ausgewählt sind aus Fettsäure-(C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>)-monoglyceriden und Fettsäure-(C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>)-Sorbitanmono- oder -diestern.
4. Zubereitung gemäß einem der Patentansprüche 1 - 3, dadurch gekennzeichnet, daß als unpolare Fettstoffe Paraffinwachs oder Triglyceride von gesättigten C<sub>10</sub>-C<sub>22</sub>-Fettsäuren oder von Hydroxystearinsäure enthalten sind.
5. Zubereitung gemäß einem der Patentansprüche 1 - 4, dadurch gekennzeichnet, daß als wasserlöslicher Wirkstoff ein keratinhärtendes, schweißhemmendes Salz, bevorzugt ein Aluminiumsalz, enthalten ist.

6. Zubereitung gemäß einem der Patentansprüche 1 – 5, dadurch gekennzeichnet, daß 25 bis 60 Gew.-% Wasser oder eines Gemisches aus Wasser und bis zu 10 Gew.-% eines wasserlöslichen Glycols oder Polyols mit 2 – 6 C-Atomen enthalten ist.
7. Zubereitung gemäß einem der Patentansprüche 1 – 6, dadurch gekennzeichnet, daß bis zu 10 Gew.-% weiterer Hilfs- und Zusatzmittel enthalten sind.
8. Zubereitung gemäß einem der Patentansprüche 1 – 7, dadurch gekennzeichnet, daß sie 0,1 – 10 Gew.-% einer feinteilig emulgierten oder mikroemulgierten Ölkomponente mit einer Tröpfchengröße unter 300 nm enthält.
9. Zubereitung gemäß Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, daß die Ölkomponente ausgewählt ist aus flüssigen Kohlenwasserstoffen, Di-n-alkylethern, Fettsäure- oder Fettalkoholestern, Silikonölen oder Gemischen davon.
10. Verfahren zur Herstellung einer Zusammensetzung gemäß Patentanspruch 8 oder 9, dadurch gekennzeichnet, daß man die Ölkomponente in Form einer besonders feinteiligen Öl-in-Wasser-Emulsion mit einer Tröpfchengröße unter 300 nm oder in Form einer Mikroemulsion in der Wärme und vor dem Erstarren der Zusammensetzung einarbeitet.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 99/03068

A61K7/38      A61K7/00

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
IPC 6      A61K7/32      A61K7/48

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6      A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 295 071 A (PROCTER & GAMBLE) 14 December 1988 (1988-12-14) abstract page 2, line 38 - page 5, line 7 page 6, line 2 - line 59	1-7
Y	DE 196 02 902 A (HENKEL KGAA) 31 July 1997 (1997-07-31) abstract column 1, line 1 - column 2, line 24 column 2, line 53 - column 3, line 8 column 3, line 54 - column 4, line 49	8-10
X	EP 0 385 763 A (RICHARDSON VICKS INC) 5 September 1990 (1990-09-05) page 2, line 51 - page 3, line 46 page 5, line 13 - page 6, line 20 page 7, line 26 - page 8, line 21	8-10
A	---	1-5,7
	---	8

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

Date of the actual completion of the international search

31 August 1999

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"S" document member of the same patent family

Date of mailing of the international search report

06/09/1999

Authorized officer

Cielen, E

Name and mailing address of the ISA  
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 apo nl.  
Fax: (+31-70) 340-3016

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inte onal Application No

PCT/EP 99/03068

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 4 803 195 A (HOLZNER GUENTER) 7 February 1989 (1989-02-07) column 2, line 64 - column 4, line 44 examples 3.8 -----	1,2,5-9

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**  
information on patent family members

Inte: International Application No  
PCT/EP 99/03068

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date	
EP 0295071 A	14-12-1988	NONE		
DE 19602902 A	31-07-1997	WO EP 9726859 A ·0876138 A	31-07-1997 11-11-1998	
EP 0385763 A	05-09-1990	US AU CA JP MX	4919934 A 640366 B 5060790 A 2010919 A,C 2288817 A 166137 B	24-04-1990 26-08-1993 06-09-1990 02-09-1990 28-11-1990 21-12-1992
US 4803195 A	07-02-1989	CH AU AU CA DE EP JP JP ZA	675966 A 609356 B 1196788 A 1299108 A 3871544 A 0279328 A 2574365 B 64000012 A 8801101 A	30-11-1990 26-04-1991 25-08-1988 21-04-1992 09-07-1992 24-08-1988 22-01-1997 05-01-1989 12-08-1988

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/03068

A. KLAFFISIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
 IPK 6 A61K7/32 A61K7/48 A61K7/38 A61K7/00

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestpräfiziert (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestpräfiziert gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie <sup>3</sup>	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 295 071 A (PROCTER & GAMBLE) 14. Dezember 1988 (1988-12-14)	1-7
Y	Zusammenfassung Seite 2, Zeile 38 - Seite 5, Zeile 7 Seite 6, Zeile 2 - Zeile 59 ---	8-10
Y	DE 196 02 902 A (HENKEL KGAA) 31. Juli 1997 (1997-07-31) Zusammenfassung Spalte 1, Zeile 1 - Spalte 2, Zeile 24 Spalte 2, Zeile 53 - Spalte 3, Zeile 8 Spalte 3, Zeile 54 - Spalte 4, Zeile 49 ---	8-10
X	EP 0 385 763 A (RICHARDSON VICKS INC) 5. September 1990 (1990-09-05)	1-5,7
A	Seite 2, Zeile 51 - Seite 3, Zeile 46 Seite 5, Zeile 13 - Seite 6, Zeile 20 Seite 7, Zeile 26 - Seite 8, Zeile 21 ---	8
		-/-

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu antnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldeatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchebericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldeatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldeatum oder dem Prioritätsatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfindenscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"V" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindenscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"S" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

Absendedatum des internationalen Rechercheberichts

31. August 1999

06/09/1999

Name und Postanschrift der internationalen Recherchebehörde

Europäisches Patentamt, P. B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Cielan, E

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/03068

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	US 4 803 195 A (HOLZNER GUENTER) 7. Februar 1989 (1989-02-07) Spalte 2, Zeile 64 - Spalte 4, Zeile 44 Beispiele 3,8 -----	1,2,5-9

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Int. Klasse Patenzeichen

PCT/EP 99/03068

im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
EP 0295071	A	14-12-1988	KEINE		
DE 19602902	A	31-07-1997	WO EP	9726859 A 0876138 A	31-07-1997 11-11-1998
EP 0385763	A	05-09-1990	US AU AU CA JP MX	4919934 A 640366 B 5060790 A 2010919 A,C 2288817 A 166137 B	24-04-1990 26-08-1993 06-09-1990 02-09-1990 28-11-1990 21-12-1992
US 4803195	A	07-02-1989	CH AU AU CA DE EP JP JP ZA	675966 A 609356 B 1196788 A 1299108 A 3871544 A 0279328 A 2574365 B 64000012 A 8801101 A	30-11-1990 26-04-1991 25-08-1988 21-04-1992 09-07-1992 24-08-1988 22-01-1997 05-01-1989 12-08-1988

**WO 99/59537**

International application filed on 5 May 1999

Applicants: Henkel KGaA

Cosmetic stick preparations

Abstract: Shaped preparations preferably in stick form containing from 25 to 70% by weight of a material melting in the range between 25 and 70 °C and consisting of polar lipids and optionally nonpolar fats and optionally active agents dissolved therein, from 0.1 to 5.0 % by weight of a water-soluble surfactant, from 1 to 25% by weight of a water-soluble active agent or solvent, and from 20 to 60% by weight of water or a finely divided emulsion or microemulsion of an oil component having a droplet size smaller than 500 nm, are useful as carriers for water-soluble active agents for example for perspiration-inhibiting aluminium salts or for pigments, for application of the said actives or pigments to the skin. Deodorant and antiperspirant sticks are the preferred areas of application.

**“Cosmetic stick preparations”**

The invention relates to shaped preparations preferably in the form of a stick for applying water-soluble cosmetic active agents to the skin.

Two variants of cosmetic and dermatological stick preparations for applying water-soluble active agents are normally available on the market, namely gels in which the active agent is dissolved in an aqueous alcohol or polyol which is gelled with a gelling agent, for example soap, and suspension sticks in which the active agent is dispersed in an anhydrous oil, for example a silicone oil, which is solidified with a wax.

Soap gel sticks have the disadvantage that they have an alkaline pH which is due to the gelling agent and creates problems when incorporating acidic actives, for example aluminium chlorohydrate or other acidic antiperspirant agents. Anhydrous dispersion sticks, in particular those based on volatile silicone oils, have the disadvantage that the dispersed actives can easily leave visible product residues on skin and clothing. Also, sticks of this kind are

relatively expensive because the oil components used as carriers for the actives are more expensive than water.

Emulsion stick preparations have also been described. From EP A 0,291,334 there is for example known a transparent antiperspirant stick that contains large amounts of a liquid oil which is processed into a transparent microemulsion gel with the assistance of a hydrophilic emulsifier and water. Such gels are also known from the literature as ringing gels and after application they leave a greasy film on the skin which the user finds very unpleasant. From WO 96/06594 there is known a water-in-oil antiperspirant composition, but it does not have the firmness and dimensional stability required for a stick preparation.

Consequently the aim was to develop a cosmetic stick preparation that would be useful as a carrier for water-soluble actives or for pigments, which would have the desired mechanical stability at ambient temperature and an adequate, non-smearing payout when applied to the skin which will feel dry after the water has evaporated off.

In German patent application DE 198 21 691.2 there have already been described stick preparations which are dispersions of lipid and wax crystals in water and which are stabilised with small amounts of hydrophilic surfactants. Although these stick preparations are highly satisfactory as regards stability, payout and skin-cooling effect, it was still desirable to improve the skin feel and care benefit even further.

This aim is achieved in the invention by a shaped preparation for applying water-soluble actives to skin, preferably in stick form, characterised by a content of from 25 to 70% by weight of a material melting in the range between 25 and 70 °C consisting of  
(A) at least 60% by weight of one or more polar lipids, and  
(B) up to 40% by weight of nonpolar fats and optionally cosmetic or dermatological actives dissolved in this material  
from 0.1 to 5% by weight of a water-soluble surfactant  
from 1 to 25% by weight of a water-soluble active agent and/or solvent

from 20 to 60% by weight of water or of a finely-divided emulsion or microemulsion of an oil component with a droplet size of less than 500 nm

The shaped preparations of the invention are dispersions of lipid and wax crystals which are stabilised with very small amounts of hydrophilic surfactants and which, because they contain water, create a fresh, lightly cooling impression on the skin when used, this making them extremely useful in particular for cosmetic applications in the deodorant field. The structure is firm and stable enough for sticks to be formed from the material and the melting behaviour is determined (i) by the nature of the lipids and oils, and (ii) by the structure and composition of the preparations, such that when spread on the skin, the temperature of the body initiates a melting process which enables the stick material to be delivered uniformly onto the skin. Also, the very finely emulsified oil components which are contained in the preparations preferably in an amount of from 0.1 to 10% by weight, provide a smooth and cosmetically satisfactory skin feel and provide a good care benefit for the skin.

The preparations of the invention are particularly useful for delivering cosmetic or dermatological actives to the skin. These can be either lipophilic, fat-soluble actives which are dissolved in the lipid phase, or water-soluble actives. The latter are a particular problem for conventional stick materials because these materials are either anhydrous or are soap-hardened gels which are incompatible with many water-soluble active agents. However, the preparations of the invention contain an external aqueous phase in which any water-soluble agents can be dissolved.

The dispersed lipid phase which consists of at least 60% by weight of one or more polar lipids (A) and up to 40% by weight of nonpolar fats should be solid at 25 °C but it should melt between 25 and 70 °C, it being preferred for a portion of this phase to start melting at temperatures below 35 °C.

As polar lipids (A) there are understood fats that are substantially insoluble in water but which have polar groups such as for example hydroxyl groups or carboxyl groups as well as lipophilic, preferably linear alkyl or acyl groups with from 8 to 22 carbon atoms. Examples

of useful polar lipids are for example fatty acids or fatty alcohols, fatty acid monoethanol-amides or fatty acid monoisopropanolamides, fatty acid mono or diglycerides, fatty acid mono or diesters of sorbitan or methyl glucoside with fatty acids having from 8 to 22 C atoms.

Preferred polar lipids for the preparations of the invention are selected form fatty acids or fatty alcohols with from 12 to 22 carbon atoms, partial esters of fatty acids with from 12 to 22 carbon atoms and glycols or polyols with from 2 to 10 carbon atoms, fatty acid monoalkanol amides with from 12 to 22 carbon atoms in the acyl residue and from 2 to 4 carbon atoms in the alkanol residue.

Also useful are industrially readily-accessible ester mixtures obtained by esterifying glycerol or sorbitol with from 1 to 2 moles of fatty acid. Other useful polar lipids are fatty acid mono and diester mixtures of methylglucoside or butylglucoside or diglycerol, and fatty alcohols with from 16 to 40 carbon atoms.

As the nonpolar fats (B) there are useful all known physiologically tolerated fats, waxes and paraffins. Useful waxes are for example beeswax, carnauba wax, candelilla wax, spermaceti and synthetic fatty acid fatty alcohol esters such as for example cetyl palmitate or stearyl stearate. Preferred nonpolar fats are primarily paraffin waxes or triglycerides of saturated C<sub>10</sub>-C<sub>22</sub> fatty acids or hydroxystearic acid. Examples of saturated triglycerides are primarily hydrogenated triglyceride fats, for example hydrogenated coconut oil, hydrogenated palm oil, or hydrogenated castor oil. Other useful nonpolar fats are the synthetic full esters of fatty acids and glycols or polyols with from 2 to 6 C atoms, for example 1,2-propyleneglycol distearate or ethylene glycol dipalmitate, as well the full esters of fatty alcohols and di or tricarboxylic acids, for example dicetyl succinate or dicetyl/stearyl adipate.

It is not necessary for the components of the material that melts between 25 and 70 °C to also melt within this temperature range, and one component or part of a component can still be liquid at 25 °C. It is important that the mass of lipids (A + B) and lipophilic actives optionally contained therein has, in admixture, a melting behaviour which commences at 25-35 °C and gives a clear melt by the time a temperature of 70 °C is reached.

The lipophilic oil-soluble actives can for example be oil-soluble vitamins, for example tocopherols, retinol derivatives, oil-soluble deodorants, for example triethyl citrate, oil-soluble UV-filters and all known cosmetic or dermatological actives that are soluble in the lipid melt.

As water-soluble surfactants there are in principle useful all surface-active materials which exhibit a solubility in water at 20 °C of at least 1% by weight and preferably 10% by weight. It does not matter whether these surfactants are nonionic or ionic, for example anionic, zwitterionic, amphoteric or cationic. The common feature of such surfactants is a preferably linear alkyl, alkenyl or acyl group with from 8 to 18 carbon atoms and a solubilising group, for example a sulphate or sulphonate group, a carboxylate group, a polyol or polyglycol ether group or an amine oxide group. Useful anionic surfactants are for example alkyl sulphates and alkane sulphonates, α-olefin sulphonates, acyl isethionates, acyl taurides and acyl sarcosinates as well as alkylpolyglycol ether sulphates, all in the form of their alkali metal, ammonium or alkanolammonium salts.

Useful zwitterionic surfactants are for example betaine surfactants such as alkyl dimethyl acetobetaine or acylamidopropyl dimethylacetobetaine.

Useful amphoteric surfactants are for example N-alkylaminopropionic acid or N-alkylaminobutyric acid.

Preferred water-soluble surfactants for the purposes of the shaped preparations of the invention are nonionic surfactants, for example addition products of 10-30 moles ethylene oxide with fatty alcohols, fatty acids, fatty acid alkanolamides, fatty acid monoglycerides, sorbitan fatty acid esters, methylglucoside fatty acid esters or polyglycol ether-modified polysiloxanes. Especially preferred are nonionic surfactants that are free of glycol ether groups and whose hydrophilic group is an oligoglucoside residue. Such surfactants are available as alkyl glucosides, alkyl oligoglucosides and alkyl polyglucosides under the trade name Plantacare ®. They contain a glucosidically linked C<sub>10</sub>-C<sub>16</sub> alkyl group on an

(oligo)glucoside residue whose mean degree of oligomerisation is from 1 to 2. Acyl glucamides derived from glucamine are also useful as surfactants.

As water-soluble actives there can be used all cosmetic or dermatologically active materials that give clear solutions in water at 20 °C at concentrations of at least 1% by weight. Such materials are for example anionic or cationic active agents which are water-soluble in the salt form, for example vitamins such as biotin (vitamin H), ascorbic acid (vitamin C), tretinoin (vitamin A acid), pantothenic acid or sun screen agents such as 2-phenylbenzimidazole-5-sulphonic acid, 2-hydroxy-4-methoxybenzophenone-5-sulphonic acid, skin moisturisers such as for example DL-2-pyrrolidone-5-carboxylic acid or chitosan salts, antimicrobial substances such as chlorhexidine gluconate, benzoic acid, sorbic acid, and keratolytic substances such as for example Na thioglycolate, sebostatics, skin lighteners such as for example ascorbyl phosphate and anti-acne agents.

Other water-soluble cosmetic agents are for example inorganic salts such as alum ( $KAl(SO_4)_2 \cdot 12 H_2O$ ) which is used as a styptic and deodorizing substance. Keratin-hardening perspiration-inhibiting salts, in particular aluminium salts, are preferred. As well as alum, there are also useful for this purpose for example aluminium hydroxychloride, aluminium lactate, sodium aluminium chlorohydroxylactate, aluminium chlorohydroxyallantoinate, aluminium zirconium tetrachlorohydrate glycine complexes or mixtures thereof.

Other water-soluble active agents which can be applied to the skin by means of the preparations of the invention are for example skin pigmenting agents and dyes for example dihydroxyacetone, alloxan or 5,6-dihydroxyindoline salts.

Anti-inflammatory agents and agents that promote healing such as for example allantoin, panthenol and various aqueous or water-soluble plant extracts, protein hydrolysates and urea can be used as water-soluble active agents.

As pigments there can be used for example titanium dioxide, kaolin, talc, zinc oxide, zinc stearate, calcium stearate, magnesium stearate, magnesium silicate, barium sulphate and coloured pigments such as iron oxide pigments.

Finally, the preparation of the invention can in addition to water also contain water-soluble solvents in an amount that does not however exceed the water content. As water-soluble solvents there are useful primarily the lower alcohols with from 1 to 3 carbon atoms, glycols and polyols as well as polyalkylene glycols which are miscible 1:1 with water to give a clear solution at 20 °C. Useful solvents are for example ethanol, isopropanol, 1,2-propylene glycol, sorbitol, glycerol, diglycerol and polyethylene glycols with molecular weights of from 200 to 10,000.

The amount of water-soluble solvent can be easily used to control firmness, delivery (payout onto the skin) and skin feel. For example, preparations that contain lower alcohols such as for example ethanol or isopropanol, or which have a large water content, have a pleasantly cooling effect on the skin. Preferably the shaped preparations of the invention contain from 25 to 60% by weight of water or of a mixture of water and up to 10% by weight of a water-soluble glycol or polyol having 2-6 carbon atoms.

The payout, that is to say, the amount of product delivered to the skin when the stick is passed over it, can be controlled through the ratio of polar and nonpolar lipids, the water-soluble surfactant content and the ratio of lipid phase to water phase. These ratios also have an effect on the melting behaviour of the stick mass which is determined mainly - but not exclusively - by the melting behaviour of the lipid phase.

In order to improve skin feel and the care benefit, cosmetic oil components can also be added to the preparations of the invention. This can however be done to only a limited extent by addition to the lipid mass or by separate emulsification without adversely affecting or even destroying the stability of the system. It has been found, however, that such oil components can be incorporated into the composition in an amount of from 0.1 to 10% by weight in warm conditions and before hardening takes place if they are in the form of an especially finely

divided oil-in-water emulsion having a droplet size of less than 500 nm, preferably less than 300 nm.

As oil components there can be used any water-insoluble, skin-compatible oils and fats which are liquid at room temperature but which at least have a melting point below 40 °C.

Hydrocarbons that are still liquid at 20 °C, for example paraffin oils or polyolefins and synthetic hydrocarbons such as for example 1,3-di-(2-ethylhexyl)-cyclohexane (Cetiol ® S) are preferred. Another highly preferred oil component comprises di-n-alkyl ethers with a total of from 12 to 24 carbon atoms, such as for example di-n-octyl ether, di-(2-ethylhexyl) ether, lauryl methyl ether and octyl butyl ether.

An especially versatile group of cosmetic oil components is that comprising fatty acid and fatty alcohol esters, for example isopropyl myristate, n-butyl stearate, 2-ethylhexyl caprylate, cetyl oleate, glyceryl tricaprylate, coconut fatty alcohol (C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>) caprylate/caprinate, hexyldecyl laurate and others. Also useful are naturally occurring ester oils such as for example jojoba oil or plant triglyceride oils such as for example olive oil, sunflower oil, soya oil, rapeseed oil, almond oil and the liquid fractions of coconut oil or tallow, as well as synthetic triglyceride oils. Dicarboxylic acid esters such as for example di-n-butyl sebacate, di-n-butyl adipate, di-isotridecyl acetate, and di-2-ethylhexyl succinate are also useful as oil components.

Linear and cyclic polysiloxanes (silicone oils) can also be present as the oil components. The oil components are preferably selected from liquid hydrocarbons, di-n-alkyl ethers, fatty acids or fatty alcohol esters and silicone oils.

Finally, the shaped preparation of the invention can also contain further adjuncts and additives that may be needed for the required properties and effects to be obtained. These are however conventional components such as for example perfumes, colours, thickeners, pigments, talc, sheet silicates, starches, preservatives and antioxidants which can be present in the preparation in a total amount of up to 10% by weight. For example, the stability of the preparations can be improved considerably during manufacturing and filling by the addition

of water-swelling thickeners (for example water-soluble cellulose ethers, polyvinyl pyrrolidone, polyvinyl alcohol, modified starch, hydroxypropylated starch phosphates or water-soluble acrylic acid acrylate copolymers and the like). To affect the skin feel, there can be added for example starches, talc, nanospheres or silicone oil in small amounts.

The following examples illustrate the invention in greater detail:

### Examples

#### 1. Oil-free deodorant sticks

The examples of stick materials in accordance with the invention that are set out in the Table below were prepared in the following manner:

Polar lipids and nonpolar fats (waxes and paraffins) and the surfactant were brought together and heated to 80 °C until a clear melt had formed. Into this hot oil phase, there was incorporated, with stirring at 80 °C, a mixture of water, water-soluble glycols and polyols and the aluminium hydroxide. An emulsion was formed, to which the perfume oil and optionally talc were added before the emulsion solidified.

	1	2	3	4	5	6
Glyceryl monolaurate	19.7	19.7	30	20	30	30
Glyceryl monostearate	10.0	-	-	-	-	-
Glyceryl monooleate	-	10.0	-	-	-	-
Behenyl alcohol	-	-	-	-	-	5
Cetyl/stearyl alcohol	0.15	0.15	0.15	0.15	0.15	0.15
Paraffin wax 5213	20.0	20.0	-	-	-	-
Hydrogenated castor oil	-	-	-	10.0	5.0	-
Alkyl polyglucoside	0.15	0.15	0.15	0.15	0.15	0.15
Aluminium chlorohydrate	20.0	20.0	20.0	10.0	20.0	20.0
1,2-Propylene glycol	3.0	3.0	3.0	-	-	-
Glycerol	-	-	-	3.0	3.0	3.0
Perfume oil	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
Talc	-	-	-	-	-	5.0
Water	26	26	45.7	55.7	40.7	35.7

	<b>7</b>	<b>8</b>	<b>9</b>	<b>10</b>	<b>11</b>	<b>12</b>
Glyceryl monolaurate	30.0	30.0	30.0	20.0	20.0	25.0
Glyceryl monopalmitate	-	-	-	10.0	-	-
Glyceryl monostearate	-	-	-	-	10.0	-
Cetyl/stearyl alcohol	0.15	0.3	0.3	0.15	0.15	0.3
Paraffin wax 5213	-	-	-	-	-	-
Hydrogenated castor oil	10.0	10.0	10.0	5.0	5.0	15.0
Alkyl polyglucoside	0.15	0.3	0.3	0.15	0.15	0.3
Aluminium chlorohydrate	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0
1,2-Propylene glycol	-	-	-	-	-	-
Glycerol	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0	3.0
Perfume oil	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
Talc	-	-	5.0	-	-	-
Water	35.7	35.4	30.4	40.7	40.7	35.4

	<b>13</b>	<b>14</b>	<b>15</b>	<b>16</b>	<b>17</b>	<b>18</b>
Glyceryl monolaurate	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0
Glyceryl monopalmitate	-	5.0	5.0	-	-	-
Behenyl alcohol	-	-	-	-	-	5
Cetyl/stearyl alcohol	0.3	0.3	0.5	0.3	0.3	-
Paraffin 69-73	-	10.0	7.5	-	-	-
Hydrogenated castor oil	10.0	5.0	7.5	10.0	10.0	10.0
Cyclomethicone	-	-	-	-	0.5	-
Dimethicone copolyol	-	-	-	-	-	2.0
Alkyl polyglucoside	0.3	0.3	0.5	0.3	0.3	-
Aluminium chlorohydrate	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0
Talc	5.0	-	-	-	-	-
Rice starch	2.0	-	-	2.0	1.0	1.0
Perfume oil	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
Water	41.4	38.4	38.0	46.4	46.9	46.0

When the solidification temperature was reached, there was formed a still-fluid dispersion that was sufficiently stable to be filled into stick holders. After filling, the materials in the stick holders hardened to give a solid mass.

The Table below sets out the melting properties of Examples 1 to 18 (measured with a differential scanning calorimeter): the differences between the melting maxima and the solidification maxima are due to crystal-growth inhibition or a tendency to undercooling.

Example	Melting begins °C	Melting maxima °C	Solidification maxima °C
1	29	37/53	30/50
2	26	35/54	30/5
3	24	38	11
4	31	41/70	11/49
5	30	41/72	13/47
6	29	42/73	12/33
7	29	41/70	14/45
8	30	42/69	14/45
9	31	41/67	13/57
10	29	31/68	13/44
11	30	42/75	14/49
12	30	42/75	14/49
13	29	40/68	12/46
14	28	38/62	14/59
15	28	38/62	15/58
16	30	40/74	12/50
17	28	40/75	12/50
18	29	41/68	11/52

**2. Preparation of finely-divided emulsion concentrates for the incorporation of oil components into the stick preparations of the invention**

**2.1. PIT emulsion (PIT = 80 - 85 °C)**

Hexyl decyl laurate	17.5
Polydecene	17.5
Cyclomethicone	10.0
Behenyl alcohol poly-(10)-glycol ether	10.0
Water	45.0

**2.2. Microemulsions**

Di-n-octyl ether	28.0
2-Octyldodecanol	7.0
Glyceryl monooleate	5.0
Lauryl glucoside	12.0
Decyl glucoside	8.0
Water	39.0

**3. Antiperspirant cream sticks with oil components**

(Percentages for commercial products refer to the water-free actives)

	<b>19</b>	<b>20</b>	<b>21</b>	<b>22</b>	<b>23</b>	<b>24</b>	<b>25</b>	<b>26</b>	<b>27</b>
Monomuls 90-L-12	20	20	20	20	20	20	20	20	20
Cutina HR	10	10	10	-	-	-	-	-	-
Lanette 22	-	-	-	5	7	7	7	7	7
Paraffin wax 69-73	-	-	-	8	5	5	5	5	5
Emulgade PL 68/50	1	1	1	2	2	2	2	2	2
Aluminium chlorohydrate	20	20	10	10	10	10	10	10	10
Talc Pharma S	-	-	-	5	5	-	-	-	-
Perfume oil	1	1	1	1	1	1	1	1	1
PIT emulsion 2.1	5	10	3	10	10	10	5	-	-
Microemulsion 2.2	-	-	-	-	-	-	-	3	6.4
Water	42	38	55	39	40	45	50	52	48.6

## Preparation

The method of preparation was the same as that for Examples 1 to 18, and emulsion concentrates 2.1 and 2.2 were incorporated last during the cooling phase and with stirring, when the temperature of the mass was about 55 °C.

## Comparative test

A test was carried out to incorporate a coarsely-particulate emulsion (mean particle size 2000 nm) into the composition of Example 21 instead of PIT emulsion 2.1. The material that was obtained did not harden into a solid stick.

### 4. Make-up sticks (28-31)

#### Moisturiser sticks (32, 33)

#### Skin lightener sticks (34, 35)

((Percentages for commercial products refer to the water-free active)

	<b>28</b>	<b>29</b>	<b>30</b>	<b>31</b>	<b>32</b>	<b>33</b>	<b>34</b>	<b>35</b>
Monomuls 90-L-12	20	20	20	20	20	20	20	20
Lanette 22	8	8	9	9	8	8	8	9
Paraffin wax 69-73	5	5	5	5	5	5	5	5
Emulgade PL 68/50	2	2	2	2	2	2	2	2
Talc Pharma S	1.5	1.5	1.5	1.5	-	-	-	-
TiO <sub>2</sub>	3	3	3	3	-	-	-	-
Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub> (Brown 70)	0.7	0.7	0.7	0.7	-	-	-	-
Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub> (Brown 75)	0.25	0.25	0.25	0.25	-	-	-	-
Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub> (Yellow 10)	0.10	0.10	10.10	0.10	-	-	-	-
Fe <sub>2</sub> O <sub>3</sub> (Red 30)	0.02	0.02	0.02	0.02	-	-	-	-
Na hyaluronate	-	-	-	-	0.1	0.1	-	-
Herbasol extract - sage	-	-	-	-	1.0	2.0	-	-
Aqua Hamamelis	-	-	-	-	1.0	2.0	-	-
Mg ascorbyl palmitate	-	-	-	-	-	-	0.5	0.75
PIT emulsion 2.1	5.0	7.5	5.0	7.5	5.0	7.5	5.0	7.5
Preservative	1.55	1.55	1.55	1.55	1.55	1.55	1.55	1.55
Perfume oil	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
Water	51.88	49.38	50.58	48.38	55.35	50.85	56.95	53.2

The method of preparation was the same as that for Examples 19-27. The pigments were incorporated into the material at about 50 °C, after PIT-emulsion 2.1. The preservative was a combination of p-hydroxybenzoic acid methyl ester, propyl ester and phenoxyethanol (0.3 + 0.3 + 0.95% by weight).

The following commercial products were used:

Abil K4	octamethylcyclotetrasiloxane (Cyclomethicone)
Abil B 8843	dimethicone copolyol
Emulgade PL 68/50	mixture of alkyl (C <sub>16-18</sub> ) polyglucoside and cetyl/stearyl alcohol (1:1)
Cetiol PGL	hexyl decyl laurate
Nexbase 2006 FG	polydecene
Mergital B10	behenyl alcohol poly-(10)-glycol ether
Plantacare 1200	lauryl glucoside
Plantacare 2000	decyl glucoside
Monomuls 90-L-12	glyceryl monolaurate
Monomuls 90-0-18	glyceryl monooleate
Cetiol OE	di-n-octyl ether
Eutanol G	2-octyldodecanol
Cutina HR	hydrogenated castor oil
Lanette 22	behenyl alcohol
Locron L	aluminium chlorhydrate

### Claims

1. A shaped preparation for applying water-soluble active agents to the skin preferably in stick form characterised by a content of  
25 - 70% by weight of a material melting in the range 25-70 °C, consisting of
  - (A) at least 60% by weight of one or more polar lipids and
  - (B) up to 40% by weight of nonpolar fats and optionally cosmetic or dermatological actives dissolved in said material

0.1 - 5 % by weight of a water-soluble surfactant

1 - 25% by weight of a water-soluble active agent and/or solvent

20 - 60% by weight of water or a finely-divided emulsion or microemulsion of an oil component having a droplet size smaller than 500 nm.

2. A preparation according to Claim 1 characterised in that the polar lipids (A) are selected from fatty acids or fatty alcohols with from 12 to 22 carbon atoms, the partial esters of fatty acids with from 12 to 22 carbon atoms and glycols or polyols with from 2 to 10 carbon atoms, fatty acid monoalkanolamides with from 12 to 22 carbon atoms in the acyl residue and from 2 to 4 carbon atoms in the alkanol residue.
3. Preparations according to Claim 1 or 2, characterised in that the polar lipids (A) are selected from fatty acid (C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>) monoglycerides and fatty acid (C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>) sorbitan mono or diesters.
4. A preparation according to one of Claims 1 to 4, characterised in that the nonpolar fats are paraffin wax or triglycerides of saturated C<sub>10</sub>-C<sub>22</sub> fatty acids or of hydroxystearic acid.
5. A preparation according to one of Claims 1 to 4 characterised in that the water-soluble active agent is a keratin-hardening, perspiration-inhibiting salt, preferably an aluminium salt.
6. A preparation according to one of Claims 1 to 5 characterised in that it contains from 25 to 60% by weight of water or a mixture of water and up to 10% by weight of a water-soluble glycol or polyol with from 2 to 6 carbon atoms.
7. A preparation according to one of Claims 1 to 6 characterised in that it contains up to 10% by weight of other adjuncts and additives.
8. A preparation according to one of Claims 1 to 7 characterised in that it contains from 0.1 to 10% by weight of a finely emulsified or micro-emulsified oil component having a droplet size smaller than 300 nm.
9. A preparation according to Claim 8 characterised in that the oil component is selected from liquid hydrocarbons, di-n-alkyl ethers, fatty acid or fatty alcohol esters, silicone oils or mixtures thereof.

10. A method for the preparation of a composition according to Claim 8 or 9, characterised in that the oil component is incorporated in the form of an especially finely-divided oil-in-water emulsion with a droplet size smaller than 300 nm or as a microemulsion under warm conditions and before the composition solidifies.